

(19) SU⁽¹¹⁾860 463⁽¹³⁾ A1(51) МПК⁶C 07 D 471/04, A 61 K 31/415,
31/44ГОСУДАРСТВЕННЫЙ КОМИТЕТ ПО
ДЕЛАМ ИЗОБРЕТЕНИЙ И ОТКРЫТИЙ(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К АВТОРСКОМУ СВИДЕТЕЛЬСТВУ
СССР

(21), (22) Заявка: 2908344/04, 09.04.1980

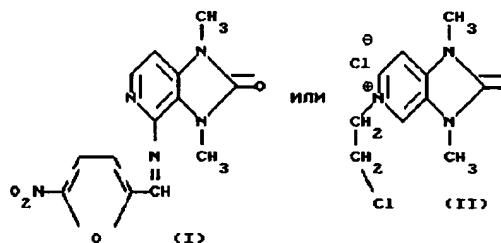
(46) Дата публикации: 27.05.1998

(56) Ссылки: 1. Talik Z., Brekiess B. Some
pyridotriazoles and imidazoles. Roczn.Chem.,
1964, 38 (5), с. 887. Цит. по Chem.Abs., 62,
с.5271 2. Ютилов Ю.М., Хабаров К.М.,
Свертилова И.А. Den N 4182-79, 1979.

(71) Заявитель:

Институт физико-органической химии и
углехимии АН Украинской ССР,
Всесоюзный научно-исследовательский
институт химических средств защиты растений(72) Изобретатель: Хабаров К.М.,
Ютилов Ю.М., Галицина В.В.(54) ПРОИЗВОДНЫЕ 4-АМИНО-1,3-ДИМЕТИЛИМИДАЗО [4,5-С] ПИРИДИН-2-ОНА, ОБЛАДАЮЩИЕ
АКАРИЦИДНЫМ ДЕЙСТВИЕМ

(57)

Производные
4-амино-1,3-диметилимидазо[4,5-с]пиридин-2-
она формулы

обладающие акарицидным действием.

SU 860 463 A1

SU 860 463 A1

(19) SU⁽¹¹⁾860 463⁽¹³⁾ A1(51) Int. Cl.⁶C 07 D 471/04, A 61 K 31/415,
31/44STATE COMMITTEE
FOR INVENTIONS AND DISCOVERIES

(12) ABSTRACT OF INVENTION

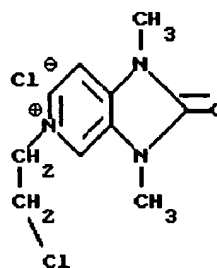
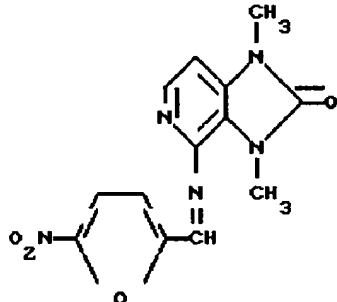
(21), (22) Application: 2908344/04, 09.04.1980

(46) Date of publication: 27.05.1998

(71) Applicant:
Institut fiziko-organicheskoy khimii i
uglekhimii AN Ukrainskoj SSR,
Vsesojuznyj nauchno-issledovatel'skij
institut khimicheskikh sredstv zashchity rastenij(72) Inventor: Khabarov K.M.,
Jutilov Ju.M., Galitsina V.V.

(54) DERIVATIVES OF 4-AMINO-1,3-DIMETHYLIMIDAZO-[4,5-C]-PYRIDINE-2-ON'E EXHIBITING ACARICIDE EFFECT

(57) Abstract:

FIELD: organic chemistry. SUBSTANCE:
product: derivatives of
4-amino-1,3-dimethyl-[4,5-c]-pyridine-2-on'e
of the formula (I)
and (II)

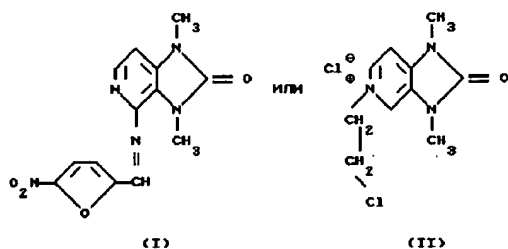
exhibiting acaricide

effect. EFFECT: enhanced effectiveness of
agents.

SU 860 463 A1

SU 860 463 A1

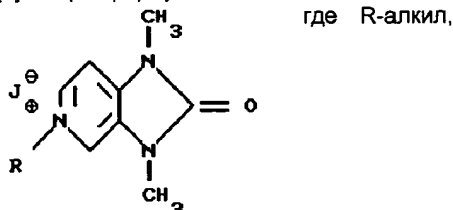
Предлагаются новые производные 4-амино-1,3-диметилимидазо [4,5-с] пиридин-2-она формулы I или II



обладающие акарицидным действием.

Известен 4-гидразиоимидазо[4,5-с] пиридин, обладающий гипотензивной активностью [1].

Известны также четвертичные соли 1,3-диметил-4-аминоимидазо[4,5-с]пиридин-2-она [2] общей формулы



бензил, аллил.

Однако данные по активности указанных соединений в литературе отсутствуют.

Целью изобретения является расширение ассортимента химических соединений, воздействующих на живой организм.

Поставленная цель достигается производными 1,3-диметил-4-аминоимидазо [4,5-с] пиридин-2-она формул I и II, обладающими акарицидным действием.

Соединение I получают путем взаимодействия 4-амино-1,3-диметилимидазо [4,5-с] пиридин-2-она с 5-нитрофурфурилом в спирте при кипении.

Соединение II получают путем взаимодействия 4-амино-1,3-диметилимидазо [4,5-с] пиридин-2-она с этиленхлоргидрином при 170-180°C с последующей обработкой хлористым тионом в хлороформе при 50-60 °C.

Пример 1.

4-(5-Нитрофурфурилен-2-амино)-1,3-диметилимидазо [4,5-с] пиридин-2-он (I).

0,8 г 4-амино-1,3-диметилимидазо [4,5-с] пиридин-2-она и 0,65 г 5-нитрофурфурилола кипятят в спирте в течение 1 ч, охлаждают, отфильтровывают выпавший осадок и сушат. Выход 1,12 г, т.пл. 238-240°C (из этанола).

Найдено, %: С 51,52; Н 4,01.

C₁₃ H₁₁ N₅ O₄

Вычислено, %: С 51,82; Н 3,68.

Пример 2. Хлорид 4-амино-5-(2'-хлорэтил)-1,3-диметилимидазо [4,5-с] пиридин-2-она (II).

0,99 г 4-амино-1,3-диметилимидазо [4,5-с] пиридин-2-она в 1,5 мл этиленхлоргидрина нагревают при 170-180°C в течение 1 ч, отгоняют этиленхлоргидрин, добавляют 10 мл сухого хлороформа и 0,5 мл хлористого тионила и нагревают при 50-60°C в течение 40 мин, охлаждают, отфильтровывают, осадок промывают его ацетоном и сушат. Выход 1,162 г, т.пл. 172-173°C (из этанола).

Найдено, %: С 42,88; Н 5,19; Cl 25,93; N 19,79.

C₁₀ H₁₄ Cl₂ N₄ O

Вычислено, %: С 43,32; Н 5,05; Cl 25,60; N 20,22.

ИК-спектр, см⁻¹: 3465 и 3265 (ν_{NH_2});

1705 ($\nu_{C=O}$).

Полученные соединения испытывают на акарицидную активность на паутинных клещах на фасоли (*Tetranychus urticae* Koch).

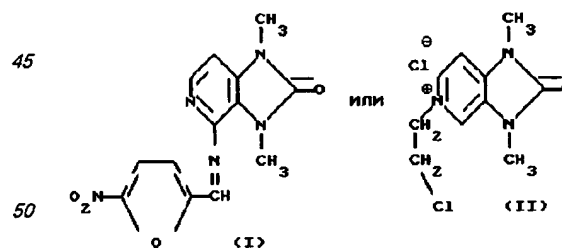
Стандартные высечки листьев фасоли с подсаженными на них взрослыми паутинными клещами опрыскивают 2,5 мл водно-ацетонового раствора испытуемого соединения в концентрации 0,1% д.в. После высыхания капельно-жидкой влаги высечки с обработанными клещами помещают во влажную камеру. Учет гибели клещей проводят через 48 ч.

Данные по акарицидной активности испытанных соединений приведены в таблице.

Таким образом, предположенные соединения обладают акарицидной активностью и могут найти широкое применение в борьбе с вредителями сельского хозяйства.

Формула изобретения:

Производные 4-амино-1,3-диметилимидазо[4,5-с]пиридин-2-она формулы



обладающие акарицидным действием.

SU 860463 A1

A1 360463 SU

Соединение	Смертность клещей от концентрации 0,1% д.в., %
Хлорид 4-амино-5-(2'-хлорэтил)-1,3- диметилимидазо[4,5-с]пиридиний-2-она	84
4-(5-Нитрофурфурилен-2-амино)-1,3- диметилимидазо[4,5-с]пиридин-2-он	85
Эталон - кельтан	100

S U 8 6 0 4 6 3 A 1

S U 8 6 0 4 6 3 A 1